

(5)

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 2000-038334

(43)Date of publication of application : 08.02.2000

(51)Int.Cl.

A61K 7/48
A61K 7/00

(21)Application number : 10-205673

(71)Applicant : POLA CHEM IND INC
KURARAY CO LTD

(22)Date of filing : 21.07.1998

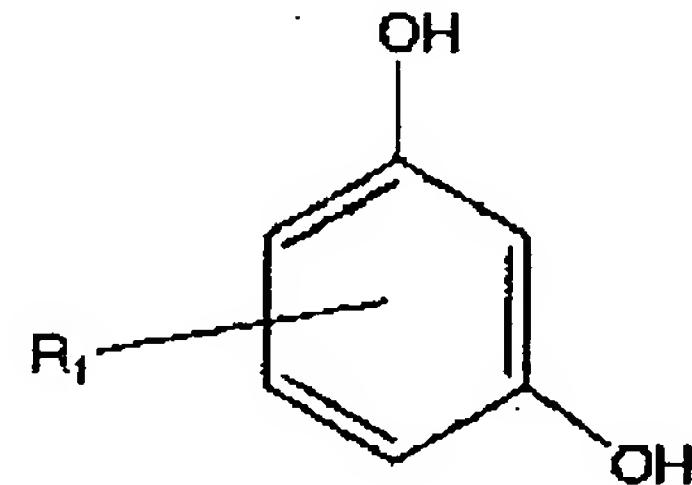
(72)Inventor : ANDO NOBUHIRO
OBARA YASUHIRO
TORIHARA MASAHIRO
TAMAI HIRONOBU

(54) BLEACHING COSMETIC CONTAINING RESORCINOL DERIVATIVE

(57)Abstract:

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain a cosmetic having excellent bleaching actions by including an alkylresorcinol and a substance such as an extract of *Betula platyphylla* Sukatchev var. *japonica* Hara.

SOLUTION: This cosmetic contains (A) an alkylresorcinol represented by the formula (R₁ is a 1-7C alkyl) (preferably a 4-alkylresorcinol or 4-n-butylresorcinol) and/or its physiologically acceptable salt and (B) at least one kind of substance selected from the group consisting of an extract of *Betula platyphylla* Sukatchev var. *japonica* Hara, an extract of *Engelhardtia chrysolepis* H. and a water-soluble soybean protein. Furthermore, the ingredient B is preferably obtained by adding a solvent, e.g. ethanol in an amount of 1-20 times that of an original crude drug or its processed material thereto and carrying out the dipping, etc., for several days in the case of room temperature. The amount of the formulated ingredients based on the total amount of the objective cosmetic are preferably 0.01-10 wt.% of the ingredient A and 0.01-10 wt.% of the ingredient B.



LEGAL STATUS

[Date of request for examination] 25.09.2002

[Date of sending the examiner's decision of rejection] 29.06.2004

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision 2004-15804
of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's 29.07.2004
decision of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

(19)日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開2000-38334

(P2000-38334A)

(43)公開日 平成12年2月8日(2000.2.8)

(51)Int.Cl.⁷

A 61 K 7/48
7/00

識別記号

F I

A 61 K 7/48
7/00

マーク(参考)

4 C 0 8 3
X
C
K

審査請求 未請求 請求項の数4 OL (全 6 頁)

(21)出願番号

特願平10-205673

(22)出願日

平成10年7月21日(1998.7.21)

(71)出願人 000113470

ポーラ化成工業株式会社
静岡県静岡市弥生町6番48号

(71)出願人 000001085

株式会社クラレ
岡山県倉敷市酒津1621番地

(72)発明者 安藤 信裕

神奈川県横浜市神奈川区高島台27番地1
ポーラ化成工業株式会社横浜研究所内

(74)代理人 100089244

弁理士 遠山 勉 (外2名)

最終頁に続く

(54)【発明の名称】 レゾルシノール誘導体を含む美白化粧料

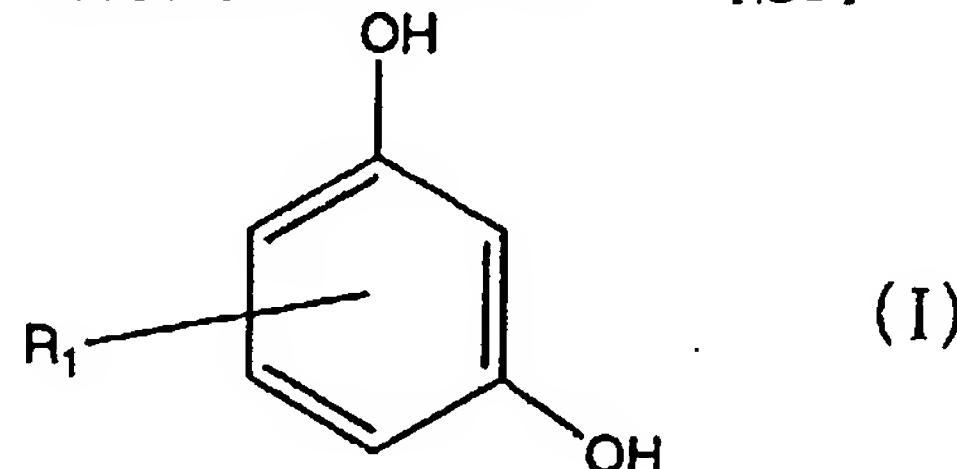
(57)【要約】

【課題】 アルキルレゾルシノールと共存物質とを併用することで優れた美白化粧料を提供することを目的とする。

【解決手段】 一般式(I)で表されるアルキルレゾル*

*シノール及び/又は生理的に許容されるその塩と、シラカバエキス、コウキエキス及び水溶性大豆蛋白から成る群から選ばれる少なくとも一種の物質を含有することを特徴とする化粧料である。

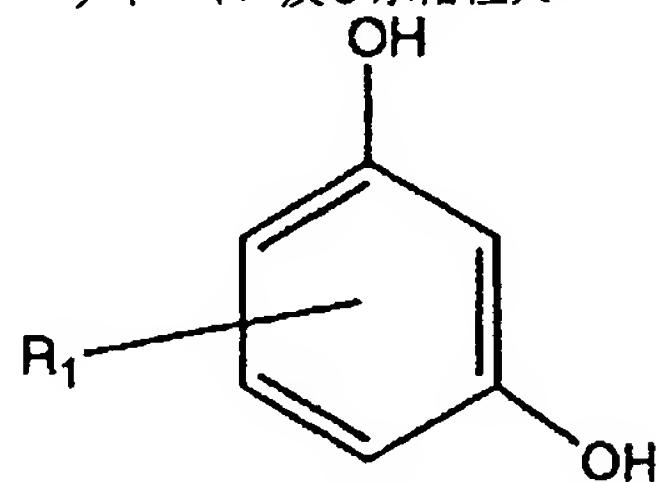
【化1】



(但し、R1は炭素数1~7のアルキル基を表す。)

【特許請求の範囲】

【請求項1】 (a) 一般式(I)で表されるアルキルレゾルシノール及び/又は生理的に許容されるその塩と、(b) シラカバエキス、コウキエキス及び水溶性大豆蛋白から成る群から選ばれる少なくとも一種の物質とを含有することを特徴とする化粧料。



(I)

(但し、R₁は炭素数1～7のアルキル基を表す。)

【請求項2】 一般式(I)で表される化合物が、4-アルキルレゾルシノールである請求項1に記載の化粧料。

【請求項3】 一般式(I)で表される化合物が、4-n-ブチルレゾルシノールである請求項1に記載の化粧料。

【請求項4】 美白用であることを特徴とする請求項1～3のいずれか1項に記載の化粧料。

20

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】 本発明は、美白化粧料に関するものである。詳しくは、アルキルレゾルシノール誘導体を含む美白化粧料に関するものである。

【0002】

【従来の技術】 シミ、ソバカスや日焼け後の皮膚の黒化等の皮膚における色素沈着は、皮膚内に存在する色素細胞(メラノサイト)の活性化によりメラニン産生が著しく亢進した結果生ずるものであり、特に中高年齢層の人々では、深刻な肌の悩みの一つになっている。従って、皮膚への色素沈着を防止、改善する物質としての美白剤が、従来から提案されてきており、例えば、アスコルビン酸とその誘導体、グルタチオンとその誘導体、ハイドロキノンとその誘導体等、種々のものが使用されてきている。これらの中で、レゾルシノール誘導体、中でも4-n-ブチルレゾルシノールに代表される、アルキルレゾルシノール誘導体は、その特異的な作用メカニズムの面で、注目を集めている。しかし、その美白効果は未だ満足すべきものではない。また、アルキルレゾルシノール誘導体の美白剤としての効果を高める研究は、今まであまりはされておらず、この誘導体を美白剤として効果的に使用する技術や方法も明らかにはされていない。

【0003】

【発明が解決しようとする課題】 本発明は、アルキルレゾルシノール誘導体と併用した場合アルキルレゾルシノール誘導体単独よりも美白作用を高める共存物質を見出し、アルキルレゾルシノール誘導体と共存物質とを併用することで優れた美白化粧料を提供することを目的とする。

* 豆蛋白から成る群から選ばれる少なくとも一種の物質とを含有することを特徴とする化粧料。

【化1】

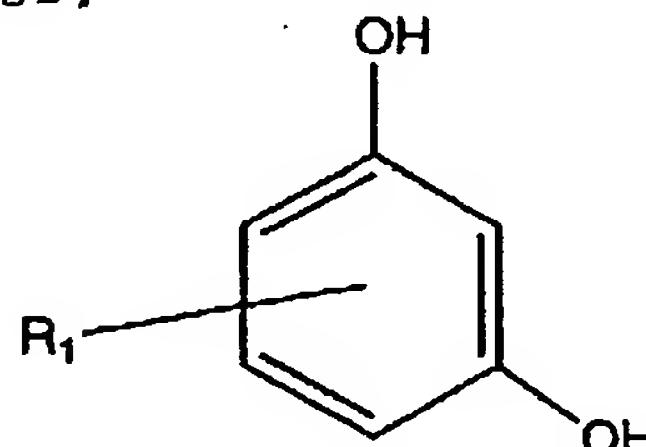
【0004】

【課題を解決するための手段】 本発明者らは、上記課題を解決するため、銳意研究を重ねた結果、シラカバエキス、コウキエキス、または水溶性大豆蛋白が、4-n-ブチルレゾルシノールに代表される、一般式(I)に表されるアルキルレゾルシノール誘導体及び/又は生理的に許容されるその塩の美白作用を著しく高める作用を有することを見いだし、本発明を完成させるに至った。

【0005】 本発明は、(a) 一般式(I)で表されるアルキルレゾルシノール及び/又は生理的に許容されるその塩と、(b) シラカバエキス、コウキエキス及び水溶性大豆蛋白から成る群から選ばれる少なくとも一種の物質を含有することを特徴とする化粧料である。

【0006】

【化2】



(I)

(但し、R₁は炭素数1～7のアルキル基を表す。)

好ましくは、一般式(I)で表される化合物が、4-アルキルレゾルシノール(ベンゼン環の4位にアルキル基を有するレゾルシノール)である前記化粧料である。

【0007】 更に、好ましくは、一般式(I)で表される化合物が、4-n-ブチルレゾルシノールである前記化粧料である。

【0008】 本発明は更に、美白用であることを特徴とする前記化粧料である。

【0009】

【発明の実施の形態】 以下、本発明を詳細に説明する。

【0010】 本発明の化粧料は、一般式(I)で表されるアルキルレゾルシノール及び/又は生理的に許容されるその塩と、シラカバエキス、コウキエキス及び水溶性大豆蛋白から成る群から選ばれるものとを含有することを特徴とする化粧料である。

50 【0011】 以下、本明細書において特に限定しないか

ぎり、アルキルレゾルシノールを、アルキルレゾルシノールとその生理的に許容される塩の両方を意味するものとして使用する。また、シラカバエキス、コウキエキス、または水溶性大豆蛋白を、共存物質ということがある。

【0012】はじめに、本発明の化粧料の成分について説明する。

【0013】(1) アルキルレゾルシノール

本発明の化粧料中、アルキルレゾルシノールは、上記一般式(I)で表される。このアルキルレゾルシノールのアルキル基としては、炭素数1～7の直鎖、分岐、環状構造を有するものの何れでも良く、例えば、メチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、tert-ブチル基、シクロプロピルメチル基等が例示できる。これらの内では炭素数4のアルキル基が好ましく、中でもn-ブチル基が好ましい。ベンゼン環へのアルキル置換基の位置は、特に限定されないが、四位の位置が好ましい。

【0014】尚、一般式(I)で表されるアルキルレゾルシノールは、既に公知の物質であって、その製法も知られている(特開平2-49715号などを参照)。即ち、レゾルシノールは、例えば飽和のカルボン酸とレゾルシノールを塩化亜鉛の存在下で縮合させた後、該縮合物を亜鉛アマルガム/塩酸で還元する方法(Lille. J. Bittner, LA. Peiner. V, Tr. Nauch - Iasled. Inst. slantsev 1969, No 18, 127参照)、または、レゾルシノールと対応するアルキルアルコールとをアルミナ触媒を使用して200～400℃の高温下で反応させる方法(英国特許第1, 581, 428号明細書参照)等によって容易に得ることができる。

【0015】又、本発明の化粧料で用いることのできる、アルキルレゾルシノールの生理的に許容される塩としては、通常化粧料などに使用され、生理的に許容されるものであれば特段の限定は受けず、例えば、ナトリウム、カリウム等のアルカリ金属塩、カルシウム、マグネシウム等のアルカリ土類金属塩、アンモニウム塩、トリエチルアミン、トリエタノールアミン等の有機アミン塩、リジン、アルギニン等の塩基性アミノ酸塩等が好ましく例示できる。

【0016】(2) 共存物質

本発明の上記アルキルレゾルシノールの美白作用を高める共存物質は、シラカバエキス、コウキエキス及び水溶性大豆蛋白から成る群から選ばれる。これらは何れも生薬由来の物質であり、既に化粧料などで広く使用されている。又、市販されているため、その入手も容易である。これらは、その薬効としては抗炎症作用などが知られているが、これらの物質が上記アルキルレゾルシノールと共に使用することにより、これらの美白作用を高めることは知られていない。

【0017】尚、本発明で言うエキスとは、これらの基

源生薬を乾燥、細切、粉碎した加工物、水蒸気蒸留したり、蒸留した蒸留物、溶媒を加え抽出した抽出物とその溶媒除去物、それらを分画精製した精製物などが例示でき、これらの中では抽出物が好ましい。抽出は、溶媒を生薬或いはその加工物に対して1～20倍量加え、室温であれば数日、沸点付近の温度であれば数時間浸漬すればよい。使用しうる溶媒に特段の限定はないが、例えば、水、エタノール、メタノールや1, 3-ブタンジオールのようなアルコール類、アセトンやメチルエチルケトンのようなケトン類、ジエチルエーテルやテトラヒドロフランの様なエーテル類、クロロホルムや塩化メチレンのようなハロゲン化炭化水素類から選ばれる1種又は2種以上が好ましく例示できる。これらの内、特に好ましいものは水もしくはアルコール類または水とアルコール類の混合物である。中でも1, 3-ブタンジオールで抽出し、不溶分を除去した後、溶媒を除去せず使用するのが特に好ましい。

【0018】又、水溶性大豆蛋白としては、大豆を1～20倍量の熱水で抽出し、冷却後不溶物をろ過などで取りのぞき、かかる後に透析などにより分子量500以下のものをカットしたものを用いるのが好ましい。

【0019】(3) 本発明の化粧料

本発明の化粧料は、アルキルレゾルシノールと、共存物質とを含有することを特徴とする化粧料である。

【0020】また、本発明の化粧料は、上述のアルキルレゾルシノールを一種又は二種以上を組み合わせて含有することもできる。本発明の化粧料に於ける、これらアルキルレゾルシノールの好ましい含有量は、化粧料全量に対して、0.01～10重量%であり、更に好ましくは0.05～5重量%である。

【0021】更に、本発明の化粧料は、上述の共存物質を一種又は二種以上を組み合わせて含有することもできる。本発明の化粧料に於いて、これら共存物質の好適な含有量は、化粧料全量に対して、0.01～10重量%であり、更に好ましくは0.05～5重量%である。これは、含有量が少なすぎると効果を発揮することができない場合があり、含有量が多すぎても効果が頭打ちになり、経済的に好ましくないためである。

【0022】また、本発明の化粧料は、これら上記の成分以外に通常化粧料で使用される任意成分を含有することができる。任意成分としては、ワセリンやマイクロクリスタリンワックス等のような炭化水素類、トレハロース等のような糖類、ホホバ油やグイロウ等のエステル類、牛脂、オリーブ油等のトリグリセリド類、セタノール、オレイルアルコール等の高級アルコール類、ステアリン酸、オレイン酸等の脂肪酸、グリセリンや1, 3-ブタンジオール等の多価アルコール類の他、これらの混合物、例えば、アクリル系ポリマーとアクリル酸の高級アルコールエステルの重合体(商品名:ペムレンTR-2(ビー・エフ・グットリッヂ社))等が好ましく例示

できる。また、非イオン界面活性剤、アニオン界面活性剤、カチオン界面活性剤、両性界面活性剤、エタノール、カルボキシビニルポリマー等の増粘剤、防腐剤、紫外線吸収剤、ビタミンE、BHT、BHA、色素、二酸化チタン、酸化亜鉛、酸化鉄、タルク、セリサイト等も、好みの任意成分として例示できる。

【0023】更に、従来より美白作用が知られている、アスコルビン酸及びその誘導体、グルタチオン及びその誘導体、アルブチンなどのハイドロキノン誘導体等を含有することも可能である。

【0024】本発明の化粧料はこれらの成分を常法に従って処理することにより得ることができる。本願発明の化粧料の剤形は、特に限定されるものではなく、具体的には、クリーム、乳液、オイル、ローション、軟膏、パック、水性ゲル、オイルゲル、浴用剤等が例示できる。経皮吸収性を考慮すると、クリーム、乳液、オイルなどが好みの剤形といえる。

【0025】尚、本発明の化粧料は、アルキルレゾルシノールを単独で含む化粧料よりも美白作用が高いため、美白化粧料、即ち、メラニン産生によって黒くなった色*20

表1 化粧水の組成

1, 3-ブタンジオール	5	重量部
エタノール	10	重量部
グリセリン	5	重量部
4-n-ブチルレゾルシノール	0.1	重量部
シラカバエキス	0.5	重量部
クエン酸ナトリウム	0.1	重量部
リン酸2水素1ナトリウム	0.1	重量部
硫酸化トレハロースナトリウム	0.2	重量部
水	79	重量部

【0029】本発明の化粧料の評価は次の様に行った。即ち、人の上腕内側部を用い、6カ所の1cm×1cmの部位を作成し、その内5部位に紫外線（光源：東芝SEランプ、照射量：最少黒化照射量の2倍）を照射し、紫外線による黒化を起こさせた。次に、その5部位中の1部位に上記化粧水を1ヶ月毎日朝晩2回塗布してもらい、黒化の減少を次の表2に示す基準で評価した。ここで最少黒化照射量とは、予め照射量のドースをふって照射を行い、照射後24時間にわずかに黒化した、個体別の照射量をいう。

【0030】

【表2】

表2 化粧料の評価基準

- ++ : 検体非投与部位に比し著しく白い
- + : 検体非投与部位に比し明らかに白い
- ± : 検体非投与部位に比しやや白い
- : 検体非投与部位と変わらない

【0031】尚、対照例として4-n-ブチルレゾルシノールとシラカバエキスを水に置換したものを用いた。

*を白くする化粧料や日焼けなどの色が黒くなる要因に曝露される前に塗布して、肌が黒くなるのを防ぐ化粧料として用いることができる。特に、老人性色沈や紫外線に起因する皮膚の黒化に対して使用するとより高い効果を得ることができる。

【0026】

【実施例】以下、本発明を実施例により更に具体的に説明するが、本発明はこれらの実施例によって限定されるものではない。

【0027】<実施例1>以下の表1に示す処方に従って、化粧水を作成した。即ち、処方成分を室温で良く攪拌し、可溶化して化粧水を得た。尚、シラカバエキスは、シラカバの樹皮1重量部に対して5重量部の1, 3-ブタンジオールを加え、90℃で3時間浸漬し、濾過した抽出物を使用した。また、4-n-ブチルレゾルシノールは、特開平2-49715号公報に記載の方法により合成した。

【0028】

【表1】

また、比較例1は4-n-ブチルレゾルシノールのみを水に置換したものを用い、比較例2はシラカバエキスのみを水に置換したものを用いた。尚、例数は5で行った。結果を表3に示す。尚、表3中の数字は、表2の各評価基準を示した例数を表す。これより、本発明の化粧料は優れた美白作用を有することがわかる。

【0032】

【表3】

表3 化粧料の評価結果

サンプル	++	+	±	-
実施例1	2	3		
比較例1		3	2	
比較例2		1	3	1
対照例				5

【0033】<実施例2>以下の表4に示す処方に従って、化粧水を作成した。即ち、処方成分を室温で良く攪拌し、可溶化して化粧水を得た。尚、コウキエキスは、

コウキの地上部1重量部に対して5重量部の1, 3-ブ
タンジオールを加え、90°Cで3時間浸漬し、濾過した
抽出物を使用した。

* 表4 化粧水の組成

1, 3-ブタンジオール	5	重量部
エタノール	10	重量部
グリセリン	5	重量部
4- <i>n</i> -ブチルレゾルシノール	0. 1	重量部
コウキエキス	0. 5	重量部
クエン酸ナトリウム	0. 1	重量部
リン酸2水素1ナトリウム	0. 1	重量部
硫酸化トレハロースナトリウム	0. 2	重量部
水	79	重量部

【0035】本発明の化粧料の評価は次の様に行った。即ち、実施例1と同様に、人の上腕内側部を用い、6カ所の1cm×1cmの部位を作成し、その内5部位に紫外線（光源：東芝SEランプ、照射量：最少黒化照射量の2倍）を照射し、紫外線による黒化を起こさせた。次に、その5部位中の1部位に化粧水を1ヶ月毎日朝晩2回塗布してもらい、黒化の減少を実施例1と同様に、表2に示す基準で評価した。

【0036】尚、対照例として4-*n*-ブチルレゾルシノールとコウキエキスを水に置換したものを用いた。また、比較例3は4-*n*-ブチルレゾルシノールのみを水に置換したものを用い、比較例4はコウキエキスのみを水に置換したものを用いた。尚、例数は5で行った。結果を表5に示す。尚、表5中の数字は、表2の各評価基準を示した例数を表す。これより、本発明の化粧料は優れた美白作用を有することがわかる。

【0037】

* 表5 化粧料の評価結果

サンプル	++	+	±	-
実施例2	2	2	1	
比較例3		2	3	
比較例4	1	1	3	
対照例			5	

【0038】<実施例3>以下の表6に示す处方に従つて、化粧水を作成した。即ち、処方成分を室温で良く攪拌し、可溶化して化粧水を得た。尚、水溶性大豆蛋白は、大豆を10倍量の熱水で抽出し、冷却後不溶物をろ過して取りのぞき、その後に透析により分子量500以下のものをカットしたものを使用した。

【0039】

*30 表6 化粧水の組成

1, 3-ブタンジオール	5	重量部
エタノール	10	重量部
グリセリン	5	重量部
4- <i>n</i> -ブチルレゾルシノール	0. 1	重量部
水溶性大豆蛋白	0. 5	重量部
クエン酸ナトリウム	0. 1	重量部
リン酸2水素1ナトリウム	0. 1	重量部
硫酸化トレハロースナトリウム	0. 2	重量部
水	79	重量部

【0040】本発明の化粧料の評価は次の様に行った。即ち、実施例1と同様に、人の上腕内側部を用い、6カ所の1cm×1cmの部位を作成し、その内5部位に紫外線（光源：東芝SEランプ、照射量：最少黒化照射量の2倍）を照射し、紫外線による黒化を起こさせた。次に、その5部位中の1部位に化粧水を1ヶ月毎日朝晩2回塗布してもらい、黒化の減少を実施例1と同様に、表2に示す基準で評価した。

【0041】尚、対照例として4-*n*-ブチルレゾルシ

ノールと水溶性大豆蛋白を水に置換したものを用いた。また、比較例5は4-*n*-ブチルレゾルシノールのみを水に置換したものを用い、比較例6は水溶性大豆蛋白のみを水に置換したものを用いた。尚、例数は5で行った。結果を表7に示す。尚、表7中の数字は、表2の各評価基準を示した例数を表す。これより、本発明の化粧料は優れた美白作用を有することがわかる。

【0042】

表7

9
表7 化粧料の評価結果

サンプル	++	+	±	-
実施例3	2	2	1	
比較例5		3	2	
比較例6		1	2	2
対照例				5

* 従って、実施例4～8の組成の化粧料（乳液）を作成した。即ち、各実施例に対応する、イ、ロ、ハの各組成の溶液を調製し、それぞれを80℃に加熱した後、イ溶液とロ溶液を混合して中和させた。次に、この混合液を攪拌しながら同様に80℃に加熱しておいたハ溶液に徐々に加え乳化させ、攪拌しながら冷却して乳液を得た。

【0044】

【表8】

【0043】<実施例4～8>以下の表8に示す処方に*

表8 化粧料の組成

成分	実施例4	実施例5	実施例6	実施例7	実施例8
(イ溶液)					
ペムレンTR-2	0.2	0.2	0.2	0.2	0.2
1,3-ブタジンオール	10	10	10	10	10
4-ジ-ブチレングリシル	0.3	0.3	0.3		
4-オクタノレゾルシノール				0.3	
4-エチルレゾルシノール					0.3
シラカバエキス	0.1			0.1	0.1
コウキエキス		0.1			
水溶性大豆蛋白			0.1		
水	30	30	30	30	30
(ロ溶液)					
水	39.15	39.15	39.15	39.15	39.15
KOH	0.05	0.05	0.05	0.05	0.05
(ハ溶液)					
セタノール	1	1	1	1	1
流動パラフィン	9	9	9	9	9
グリセリルステアレート	0.1	0.3	0.1	0.1	0.1
蔗糖脂肪酸エステル	0.1	0.3	0.1	0.1	0.1

【0045】

※と共に存物質と併用することで優れた美白化粧料が提供

【発明の効果】本発明により、アルキルレゾルシノール※30 される。

フロントページの続き

(72)発明者 小原 康弘

神奈川県横浜市神奈川区高島台27番地1
ポーラ化成工業株式会社横浜研究所内

(72)発明者 鳥原 正浩

新潟県北蒲原郡中条町倉敷町2番28号 株
式会社クラレ内

(72)発明者 玉井 洋進

新潟県北蒲原郡中条町倉敷町2番28号 株
式会社クラレ内

F ターム(参考) 4C083 AA012 AA111 AA112 AB032

AB282 AC022 AC072 AC102

AC122 AC302 AC422 AC471

AC472 AD212 AD222 AD411

AD412 CC01 CC04 EE16